



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 155 582** ⁽¹³⁾ **C2**
(51) МПК⁷ **A 61 K 9/48, 9/00, A 61 P 15/18**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 97112388/14, 21.12.1995
(24) Дата начала действия патента: 21.12.1995
(30) Приоритет: 22.12.1994 FR 9415501
(46) Дата публикации: 10.09.2000
(56) Ссылки: FR 2372635 A1, 30.06.1978. EP 359402 A1, 21.03.1990. RU 2065742 C1, 27.06.1996.
(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 22.07.1997
(86) Заявка РСТ: FR 95/01712 (21.12.1995)
(87) Публикация РСТ: WO 96/19195 (27.06.1996)
(98) Адрес для переписки: 129010, Москва, ул. Большая Спасская 25, стр.3, ООО "Городисский и Партнеры", Лебедевой Н.Г.

(71) Заявитель:
ЛАБОРАТУАР ИННОТЕРА (FR)
(72) Изобретатель: Катрин МЕНЬАН (FR)
(73) Патентообладатель:
ЛАБОРАТУАР ИННОТЕРА (FR)

(54) ДОЗИРОВАННАЯ ГАЛЕНОВА КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ ВАГИНАЛЬНОГО ПРИМЕНЕНИЯ В КАЧЕСТВЕ МЕСТНОГО КОНТРАЦЕПТИВНОГО СРЕДСТВА И/ИЛИ ДЛЯ БОРЬБЫ С ЗАБОЛЕВАНИЯМИ, ПЕРЕДАЮЩИМИСЯ ПОЛОВЫМ ПУТЕМ, И/ИЛИ ВИЧ

(57)
Галенова композиция выполнена в виде мягкой желатиновой капсулы, содержащей неводную жидкую или полужидкую фазу. Эта фаза содержит активный спермицидный компонент в растворе, липофильный агент, совместимый с резиновым латексом презерватива, диспергируемый в воде агент, биоадгезивный агент и агент для желирования липофильного агента. Доля липофильного агента больше, чем агента, диспергируемого в воде. Предпочтительный состав композиции, содержащейся в капсуле, г: бензалкония хлорид, 50 % раствор, 0,265-2,65, диоксид кремния 5-7, гидроксипропилцеллюлоза 6-8, 7-глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля 9-11, полиоксиэтиленгликоль 400 4-6, силиконовое масло - необходимое количество до общей массы 100 г. Заявлен способ получения композиции указанного выше состава. Сначала добавляют раствор

бензалкония хлорида к силиконовому маслу при перемешивании. Вводят в эту смесь полиоксиэтиленгликоль 400 и 7-глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля в жидком виде. Продукт перемешивают в течение времени, достаточного для достижения хорошей гомогенизации. Добавляют гидроксипропилцеллюлозу. Продукт перемешивают. Вводят диоксид кремния. Перемешивают до получения конечного продукта. Конечный продукт помещают в желатиновую оболочку. Состав мягкой желатиновой капсулы может одновременно включать спермицидные, антисептические и смазывающие компоненты. Композиция совместима с презервативами без риска повреждения их резинового латекса и с внешней фазой - желатином, не вызывая его денатурацию, а следовательно, расплавления до использования капсулы. 2 с. и 13 з.п.ф-лы, 1 табл.

RU 2 155 582 C2

RU 2 155 582 C2



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 155 582** ⁽¹³⁾ **C2**
(51) Int. Cl.⁷ **A 61 K 9/48, 9/00, A 61 P 15/18**

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 97112388/14, 21.12.1995

(24) Effective date for property rights: 21.12.1995

(30) Priority: 22.12.1994 FR 9415501

(46) Date of publication: 10.09.2000

(85) Commencement of national phase: 22.07.1997

(86) PCT application:
FR 95/01712 (21.12.1995)

(87) PCT publication:
WO 96/19195 (27.06.1996)

(98) Mail address:
129010, Moskva, ul. Bol'shaja Spasskaja 25,
str.3, OOO "Gorodisskij i Partnery", Lebedevoj N.G.

(71) Applicant:
LABORATUAR INNOTERA (FR)

(72) Inventor: Katrin MEN'AN (FR)

(73) Proprietor:
LABORATUAR INNOTERA (FR)

(54) **DOSED GALENICAL COMPOSITION FOR VAGINAL USE AS TOPICAL CONTRACEPTIVE AGENT AND/OR FOR CONTROL OF DISEASES CAUGHT BY SEXUAL WAY AND/OR HUMAN IMMUNODEFICIENCY VIRUS**

(57) Abstract:

FIELD: pharmacy. SUBSTANCE: galenical composition is made as soft gelatinous capsule containing nonaqueous liquid or semiliquid phase. This phase has active spermicide component in solution, lipophilic agent that is compatible with rubber latex of condom, water-dispersable agent, bioadhesive agent and agent for lipophilic agent gelling. Part of lipophilic agent exceeds that of water-dispersible agent. Composition has the following preferable ratio in capsule, g: 50% solution of benzalkonium chloride, 0.265-2.65; silicon dioxide, 5-7; hydroxypropyl-cellulose, 6-8; polyhydroxyethylene glycol 7-glycerylcocoate, 9-11; polyhydroxyethylene glycol-400, 4-6; silicon oil, the balance up to total mass 100 g. Invention claims method of preparing the above indicated

composition. At first, solution of benzalkonium chloride is added to silicon oil at stirring and polyhydroxyethylene glycol-400 and polyhydroxyethylene glycol 7-glycerylcocoate are added to this mixture. Product is stirred to obtain good homogeneity, hydroxypropylcellulose is added, product is stirred, silicon oxide is added and stirred up to the end product preparing. The end product is placed into gelatin envelope. Composition of soft gelatinous capsule can contain spermicide, antiseptic and lubricating components simultaneously. Composition is compatible with condoms without risk of damage of rubber latex and with gelatin as external phase, it does not cause its denaturation and melting before capsule using. EFFECT: improved quality and properties of composition. 15 cl, 1 tbl

RU 2 155 582 C2

RU 2 155 582 C2

Настоящее изобретение относится к дозированной галеновой композиции в форме мягкой капсулы, т.е. включающей, во-первых, внешнюю оболочку, включающую желатин, и, во-вторых, неводную жидкую или полужидкую внутреннюю фазу, содержащую спермицидный активно действующий компонент в растворе.

Более конкретно, настоящее изобретение относится к галеновой композиции этого типа для вагинального применения в качестве местного контрацептивного средства и/или борьбы с заболеваниями, передающимися половым путем, и/или ВИЧ.

В настоящее время существуют многочисленные спермицидные вещества в форме вагинальных суппозиториях, кремов, губок, импрегнированных кремом или раствором, а также таблеток для местной контрацепции. Все спермицидные агенты по своей природе являются поверхностно-активными агентами.

Например, US-A-4 983 393 и US-A-5 069 906 описывают отвержденную галеновую композицию, которая растворяется в присутствии влагалищного отделяемого, EP-A-0 587 431 описывает вагинальный суппозиторий, который растворяется во влагалище, включающий водорастворимую лиофилизированную пену и спермицидный агент, а US-A-4 187 286 описывает вагинальный суппозиторий, включающий смесь полиэтиленгликоля, спермицидного агента, загустителя, пенообразующего агента и альгиновой кислоты. EP-A-0 359 402 описывает контрацептивный вагинальный суппозиторий, обладающий пролонгированным действием, который включает спермицидный агент, полимерную смолу, диспергирующий агент и, в качестве главного наполнителя, полиоксиэтиленгликоль (ПЭГ); но этот суппозиторий представляет из себя гомогенную и твердую галеновую форму композиции, которую нельзя использовать в качестве внутренней фазы мягкой капсулы вследствие высокогидрофильной природы ПЭГ, который будет спонтанно разрушать внешнюю желатиновую фазу.

Галенова форма "мягкая капсула" хорошо известна; она имеет внешнюю фазу, которая сначала является твердой и, таким образом, с ней легко манипулировать и помещать в нужное место, и которая включает желатин, конкретно, состоит из желатина и глицерина и включает в себе жидкую или полужидкую внутреннюю фазу, содержащую лекарственный агент.

Например, FR-A-2 372 635 описывает мягкую капсулу, внутренняя фаза которой состоит, главным образом, из поверхностно-активного агента, и которая поэтому непригодна для вагинального использования по причине непереносимости ее слизистой оболочки; EP-A-0 121 321 описывает мягкую капсулу, включающую активный компонент, который находится в растворе или суспензии, а также композицию, не позволяющую мягкой капсуле становиться хрупкой.

Кроме того, распространение заболеваний, передающихся половым путем (ЗПП), за последние годы, и в частности ВИЧ-инфекции, привело к беспрецедентному росту использования презервативов. Тем не

менее, рекомендуется использовать презерватив в сочетании с подходящим смазывающим агентом, т.е. таким, который не ухудшает механическую прочность презерватива и не увеличивает его порозность вследствие воздействия на латекс.

Например, EP-A-0 457 127 описывает смазывающий агент на основе силиконового масла для обработки латекса презервативов, EP-A-0 475 664 описывает смазывающую композицию и ее применение с презервативами, а FR-A-2 666 587 описывает смазывающий агент, включающий полидиметилсилоксан.

Для большей безопасности рекомендуется также сочетать применение презерватива со спермицидным агентом (в случаях, когда презерватив применяют для контрацепции) и/или с агентом, обеспечивающим защиту от инфекций, передающихся половым путем в случаях, когда презерватив применяют для защиты от ЗПП).

Одной из целей настоящего изобретения является создание галеновой композиции, которая удовлетворяла бы всем этим разнообразным требованиям с помощью дозированной композиции для вагинального применения, обладающей известными преимуществами мягкой капсулы, которая одновременно имела бы спермицидные, антисептические и смазывающие свойства, и которая была бы также совместима с презервативами без риска повреждения их резинового латекса.

Согласно литературным данным, многие композиции для вагинального применения (гели, вагинальные суппозитории, мягкие капсулы и т.п.) обладают свойством ухудшать физические характеристики резинового латекса презервативов.

Главная проблема заключается в том, что резиновый латекс презервативов теряет свои свойства, и, в частности, прочность на разрыв, когда он контактирует со многими композициями для вагинального применения.

Помимо этого, эта галеновая композиция должна переноситься, быть стабильной и приемлемой для применения в галеновых препаратах.

Она должна удовлетворять многочисленным требованиям, в частности:

- она должна обеспечивать биоадгезию, чтобы свести к минимуму, на сколько это возможно, вытекание наружу;
- она должна гарантировать совместимость носителей с активным компонентом;
- она должна способствовать гомогенному смешиванию внутренней фазы с вагинальным секретом, будучи до некоторой степени гидрофильной, в то же время гарантируя, что ее гидрофильная природа совместима с внешней фазой, включающей желатин, чтобы избежать его денатурации (иначе капсула расплавится до того как ее используют) и
- выбранные ингредиенты должны быть совместимыми как с внешней фазой, так и с резиновым латексом презервативов.

Настоящее изобретение решает все вышеупомянутые проблемы, предлагая дозированную галеновую композицию описанного выше типа, которая характеризуется тем, что активный компонент состоит из спермицидного агента и что,

помимо активного компонента, внутренняя фаза включает: наибольшую долю липофильного агента, совместимого с резиновым латексом презерватива: меньшую долю, по крайней мере, одного диспергируемого в воде агента; по крайней мере, один биоадгезионный агент и, по крайней мере, один агент для желирования липофильного агента.

В соответствии с различными полезными дополнительными характеристиками:

- спермицидный агент выбирают из следующей группы: бензалкония хлорид; бензетония хлорид, цетилпиридиния хлорид, метилбензетония хлорид, тетрадецилтриметиламмония бромид, бензалкония бромид, нонилфениловые эфиры, лауриловые эфиры и октоксинолы; более предпочтительно, спермицидный агент находится в катионной форме и, предпочтительно, является бензалкония хлоридом;

- липофильный агент, совместимый с резиновым латексом презерватива, является силиконовым маслом;

- диспергируемый в воде агент является неионным, не поверхностно-активным соединением, предпочтительно, выбранным из следующей группы: сложные эфиры жирных кислот и многоатомных спиртов; эфир лаурилового спирта и полиэтиленгликоля; полиоксиэтиленовое касторовое масло; глицериды полиоксиэтилена; полиоксиэтиленгликоли; сахароглицериды пальмовых масел и ректифицированный этилдиэтиленгликоль; и, предпочтительно, является смесью полиоксиэтиленгликоля и 7-глицерилкоата полиоксиэтиленгликоля;

- биоадгезионный агент является биосовместимым полимером, предпочтительно, выбранным из следующей группы: карбоксивиниловые кислоты; карбоксиметилцеллюлоза; карбоксиметилцеллюлозанатрий, метилцеллюлоза, гидроксипропилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, агар-агар, силикат алюминия, карагены и карбовая камедь; и, более предпочтительно, является гидроксипропилцеллюлозой;

- агент для желирования липофильного агента выбирают из следующей группы: диоксид кремния, моностеарат алюминия, тристеарат алюминия и цетиловый спирт; и более предпочтительно диоксид кремния; и

- ее внутренняя фаза, совместимая с резиновым латексом презерватива, удовлетворяет общему составу: бензалкония хлорид, 50% раствор - от 0,265 до 2,65 г; диоксид кремния - от 5 до 7 г; гидроксипропилцеллюлоза - от 6 до 8 г; 7-глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля - от 9 до 11 г; полиоксиэтиленгликоль 400 - от 4 до 6 г; силиконовое масло - необходимое количество до общей массы 100 г.

Настоящее изобретение обеспечивает также способ получения дозированной гелевой композиции, который характеризуется тем, что состоит из: а) добавления раствора бензалкония хлорида к силиконовому маслу при перемешивании; б) инкорпорирования в смесь а) полиоксиэтиленгликоля 400 и 7-глицерилкоата полиоксиэтиленгликоля в жидком виде; с) перемешивания продукта б) в течение времени, достаточного для

достижения хорошей гомогенизации; d) добавления гидроксипропилцеллюлозы к продукту с); е) перемешивания продукта d); f) инкорпорирования диоксида кремния и g) перемешивания до получения конечного продукта, который помещают в оболочку, включающую желатин.

Разнообразные преимущества и характеристики настоящего изобретения становятся ясными из следующих примеров.

Во всех примерах настоящего изобретения упоминается состав внутренней фазы; подразумевается, что она помещается во внешнюю оболочку, включающую желатин, в частности во внешнюю оболочку из желатина/глицерина, известную как "мягкая капсула".

Если не указывается иное, примеры даны для количества в 100 граммов.

Пример 1

Бензалкония хлорид, 50% раствор - 2,65 г

Тристеарат алюминия - 2 г

Метилцеллюлоза - 10 г

Глицериды полиоксиэтилена (Labrafil CS 1944[®]) - 10 г

Силиконовое масло - До 100 г
(т.е. 75,35% масла и 10% диспергируемого в воде агента)

Пример 2

Ноноксинол 9 - 8 г

Цетиловый спирт - 5 г

Карбоксивиниловая кислота (Carbopol 944 P[®]) - 2 г

Гидроксипропилметилцеллюлоза - 5 г

Полиоксиэтиленгликоль 400 - 7 г

Силиконовое масло - До 100 г

(т.е. 73% масла и 7% диспергируемого в воде агента)

Пример 3

Лауриловый эфир (Laureth 9) - 7 г

Диоксид кремния - 5 г

Карбоксивиниловая кислота (Carbopol 944 P[®]) - 2 г

Монолаурат полиоксиэтиленгликоля 400 - 4 г

Глицериды полиоксиэтилена (Labrafil CS 1944[®]) - 8 г

Силиконовое масло - До 100 г

(т.е. 74% масла и 12% диспергируемого в воде агента)

Пример 4

Бензалкония хлорид, 50% раствор - 2 г

Диоксид кремния - 5 г

Метилцеллюлоза - 8 г

Полиоксиэтиленовое касторовое масло - 5 г

7-Глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля
(Cetiol HE[®]) - 8 г

Силиконовое масло - До 100 г

(т.е. 72% масла и 13% диспергируемого в воде агента)

Пример 5

Бензетония хлорид - 1 г

Моностеарат алюминия - 2 г

Гидроксипропилметилцеллюлоза - 7 г

7-Глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля
(Cetiol HE[®]) - 9 г

Полиоксиэтиленгликоль 400 - 6 г

Силиконовое масло - До 100 г

(т.е. 75% масла и 15% диспергируемого в воде агента)

Пример 6

Октоксинол 9 - 6 г

Цетиловый спирт - 5 г
 Карбоксивиниловая кислота (Carbopol EX 55®) - 3 г
 Глицериды полиоксиэтилена (Labrafil CS 1944®) - 7 г
 Силиконовое масло - До 100 г
 (т.е. 79% масла и 7% диспергируемого в воде агента)
 Пример 7
 Метилбензетония хлорид - 1,5 г
 Диоксид кремния - 6 г
 Карбоксиметилцеллюлоза - 7 г
 Монолаурат полиоксиэтиленгликоля 400 - 4 г
 Ректифицированный этилдиэтиленгликоль (Transcutol®) - 2 г
 Силиконовое масло - До 100 г
 (т.е. 79,5% масла и 6% диспергируемого в воде агента)
 Пример 8
 Бензалкония хлорид, 50% раствор - 2,52 г
 Тристеарат алюминия - 1,5 г
 Метилцеллюлоза - 5 г
 Глицериды полиоксиэтилена (Labrafil CS 1944®) - 8 г
 Полиоксиэтиленгликоль 200 - 4 г
 Силиконовое масло - До 100 г
 (т.е. 78,98% масла и 12% диспергируемого в воде агента)
 Пример 9
 Бензалкония хлорид, 50% раствор - 2,52 г
 Диоксид кремния - 6 г
 Гидроксипропилцеллюлоза - 7 г
 7-Глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля (Cetiol NE) - 10 г
 Полиоксиэтиленгликоль 400 - 5 г
 Силиконовое масло - До 100 г
 (т.е. 69,48% масла и 15% диспергируемого в воде агента)
 Дозированная галенова композиция настоящего изобретения, как показано на вышеперечисленных примерах, обладает тем преимуществом, что имеет одновременно смазывающие и спермицидные свойства, в то же время обладая также эффективностью в отношении заболеваний, передающихся половым путем, и ВИЧ, и оставаясь полностью совместимой с резиновым латексом презервативов.
 Тесты на совместимость между дозированной галеновой композицией настоящего изобретения и резиновым латексом презервативов, выполненные в соответствии со стандартом AFNOR NFS 97-031, принятом в мае 1993, не показали значимого ухудшения свойств презервативов, в частности их прочности на разрыв.
 Были проведены также испытания представленных образцов, а именно, 50 мягких капсул, соответствующих композиции вышеприведенного примера 9, в National Testing Laboratory.
 Процедура испытаний была следующей: тест на разрыв (измерялось давление и объем при разрыве) в соответствии со стандартом NFS 97-031, 5.2, принятом в мае 1993, выполняли на 20 мужских презервативах каждого типа при следующих условиях:
 - мужские презервативы, готовые для использования (смазанные и индивидуально упакованные) и
 - мужские презервативы при тех же условиях, но с нанесенным на них кисточкой

вышеупомянутым продуктом в количестве 500 ± 30 мг при экспозиции 30 минут.

Три типа мужских презервативов, применявшихся в испытаниях, были следующими:

- Prophyltex "SN Special", гладкая поверхность, серия No.231 005, толщина 60 мкм;

- Prophyltex "Stymuleve", текстурированная поверхность, серия No. 341 201, толщина 60 мкм; и

- Manix "Contact", гладкая поверхность, серия N. LD 103 F12, толщина 50 мкм.

Были получены следующие результаты (см. табл. 1 в конце описания).

По результатам этих испытаний можно сделать вывод об отсутствии значимого изменения давления или объема при разрыве до и после нанесения на презервативы вещества настоящего изобретения.

Для того, чтобы соответствовать идее биоадгезии галеновой композиции настоящего изобретения и избежать феномена вытекания наружу, насколько это возможно, внутренняя фаза в примерах настоящего изобретения содержит биосовместимые биоадгезионные полимеры, обладающие свойством инкорпорировать максимальное количество влаги для повышения вязкости дозированной галеновой композиции настоящего изобретения и, таким образом, пролонгировать пребывание указанной композиции непосредственно на месте ее действия.

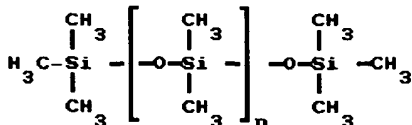
Совместимость носителей с катионным поверхностно-активным агентом, представляющим активно действующий компонент, получали путем использования неионных наполнителей.

Для того, чтобы соответствовать идее биоадгезии, в состав включили неионные полимеры, совместимые с внутренней фазой, предпочтительно производные целлюлозы.

Феномен вытекания наружу был сведен к минимуму, насколько это возможно, путем желирования неводной внутренней фазы с помощью агента, желирующего липофильный агент.

В настоящем изобретении, по меньшей мере, один из ингредиентов внутренней фазы способствует получению однородной смеси влажнотного отделяемого и липофильного производного, который является главным ингредиентом жирной фазы, гарантируя, что природа дозированной галеновой композиции будет до некоторой степени гидрофильной. Тем не менее, эта гидрофильная природа должна оставаться совместимой с внешней фазой, поскольку, в противном случае, внешняя желатиновая структура будет разрушаться под влиянием слишком гидрофильной внутренней фазы.

Липофильный компонент настоящего изобретения является совместимым с поверхностно-активным агентом с оболочкой, включающей желатин, и, помимо всего прочего, с резиновым латексом презервативов. В настоящем изобретении таким липофильным агентом является силиконовое масло, конкретно, полидиметилсилоксан следующей формулы:



в которой n лежит в пределах от 400 до 1200.

Это прозрачная бесцветная жидкость без запаха с различной вязкостью, практически не растворима в воде и в метаноле, смешивается с этилацетатом, хлороформом, эфиром, метилэтилкетонном, четыреххлористым углеродом и толуолом.

Использованное силиконовое масло, которое является диметилполисилоксаном типа Dimeticone 1000^R, соответствует требованиям 10 издания Французской Фармакопеи и 2 издания Европейской Фармакопеи. Его вязкость лежит в пределах от $950 \cdot 10^{-6} \text{ м}^2/\text{с}$ до $1050 \cdot 10^{-6} \text{ м}^2/\text{с}$ (от 950 до 1050 сантистокс).

Настоящее изобретение, таким образом, относится к дозированной галеновой композиции для вагинального применения в форме мягкой капсулы, которая особенно удобна для применения с резиновым латексом презервативов, обеспечивает противозачаточное действие и обладает эффективностью в отношении заболеваний, передающихся половым путем, и ВИЧ.

Формула изобретения:

1. Дозированная галенова композиция для вагинального применения в качестве местного контрацептивного средства и/или для борьбы с заболеваниями, передающимися половым путем, и/или ВИЧ, включающая внешнюю оболочку, содержащую желатин, и неводную жидкую или полужидкую внутреннюю фазу, содержащую активный компонент в растворе, причем указанная композиция отличается тем, что активный компонент представляет собой спермицидный агент, и тем, что внутренняя фаза, помимо активного компонента, включает наибольшую долю липофильного агента, совместимого с резиновым латексом презерватива, меньшую долю, по крайней мере, одного диспергируемого в воде агента, по крайней мере, один биоадгезионный агент и, по крайней мере, один агент для желирования липофильного агента.

2. Дозированная галенова композиция по п. 1, отличающаяся тем, что спермицидный агент выбирают из следующей группы: бензалкония хлорид, бензетония хлорид, цетилпиридиния хлорид, метилбензетония хлорид, тетрадецилтриметиламмония бромид, бензалкония бромид, нонилфениловые эфиры, лауриловые эфиры и октоксинолы.

3. Дозированная галенова композиция по п.2, отличающаяся тем, что спермицидный агент более предпочтительно находится в катионной форме.

4. Дозированная галенова композиция по п.3, отличающаяся тем, что спермицидный агент является бензалкония хлоридом.

5. Дозированная галенова композиция по п.1, отличающаяся тем, что липофильный агент, совместимый с резиновым латексом презерватива, является силиконовым маслом.

6. Дозированная галенова композиция по п.1, отличающаяся тем, что диспергируемый в воде агент является неионным, не

поверхностно-активным соединением.

7. Дозированная галенова композиция по п.6, отличающаяся тем, что неионный, не поверхностно-активный диспергируемый в воде агент выбирают из следующей группы: сложные эфиры жирных кислот и многоатомных спиртов, эфир лаурилового спирта и полиэтиленгликоля, полиоксиэтиленовое касторовое масло, глицериды полиоксиэтилена, полиоксиэтиленгликоли, сахароглицериды пальмовых масел и ректифицированный этилдиэтиленгликоль.

8. Дозированная галенова композиция по п.7, отличающаяся тем, что неионный, не поверхностно-активный диспергируемый в воде агент представляет из себя смесь полиоксиэтиленгликоля и 7-глицерилкоата полиоксиэтиленгликоля.

9. Дозированная галенова композиция по п.1, отличающаяся тем, что биоадгезионный агент является биосовместимым полимером.

10. Дозированная галенова композиция по п. 9, отличающаяся тем, что указанный полимер выбирают из следующей группы: карбоксиметилцеллюлоза, натрий карбоксиметилцеллюлоза, метилцеллюлоза, гидроксипропилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, агар-агар, силикат алюминия, карагены и каробовая камедь.

11. Дозированная галенова композиция по п.10, отличающаяся тем, что биоадгезионный агент предпочтительно является гидроксипропилцеллюлозой.

12. Дозированная галенова композиция по п.1, отличающаяся тем, что агент для желирования липофильного агента выбирают из следующей группы: диоксид кремния, моностеарат алюминия, тристеарат алюминия и цетиловый спирт.

13. Дозированная галенова композиция по п.12, отличающаяся тем, что агент для желирования липофильного агента более предпочтительно является диоксидом кремния.

14. Дозированная галенова композиция по п.1, отличающаяся тем, что ее внутренняя фаза, совместимая с резиновым латексом презерватива, удовлетворяет общему составу, г:

Бензалкония хлорид, 50% раствор - 0,265 - 2,65

Диоксид кремния - 5 - 7

Гидроксипропилцеллюлоза - 6 - 8

7-Глицерилкоат полиоксиэтиленгликоля - 9 - 11

Полиоксиэтиленгликоль - 4 - 6

Силиконовое масло - Необходимое количество до общей массы 100

15. Способ получения дозированной галеновой композиции в соответствии с п. 14, отличающийся тем, что состоит из: а) добавления раствора бензалкония хлорида к силиконовому маслу при перемешивании, б) введения в смесь а) полиоксиэтиленгликоля 400 и 7-глицерилкоата полиоксиэтиленгликоля в жидком виде, с) перемешивания продукта б) в течение времени, достаточного для достижения хорошей гомогенизации, д) добавления гидроксипропилцеллюлозы к продукту с), е) перемешивания продукта д), ф) введения диоксида кремния и г) перемешивания до

получения конечного продукта, который

помещают в оболочку, включающую желатин.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

RU 2155582 C2

RU 2155582 C2

Таблица 1

Тип презерватива	Объем при разрыве		Давление при разрыве	
	(дм ³)		(кПа)	
	без по- крытия	с покры- тием	без по- крытия	с покры- тием
<u>Prophyltex</u>				
<u>"SN Spécial"</u>				
средняя величина	30,2	40,2	1,87	1,92
стандартное откл.	4,6	1,9	0,18	0,08
<u>Prophyltex</u>				
<u>"Stymuléve"</u>				
средняя величина	37,9	32,2	1,65	1,60
стандартное откл.	5,2	8,2	0,09	0,10
<u>Manix "Contact"</u>				
средняя величина	37,9	40,4	1,56	1,46
стандартное откл.	5,2	5,1	0,08	0,12

RU 2155582 C2

RU 2155582 C2